

EUROPEAN PATENT OFFICE

Patent Abstracts of Japan

PUBLICATION NUMBER : 07025853
PUBLICATION DATE : 27-01-95

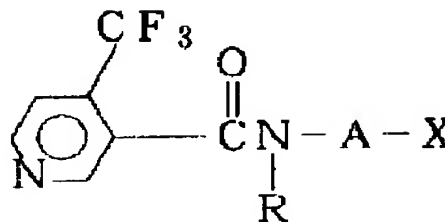
APPLICATION DATE : 14-07-93
APPLICATION NUMBER : 05196888

APPLICANT : ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD;

INVENTOR : KAGIMOTO CHIHARU;

INT.CL. : C07D213/82 A01N 43/40 A01N 43/42
A01N 43/58 A01N 43/60 A01N 43/78
A01N 43/80 C07D401/12 C07D405/12
C07D409/12

TITLE : AMIDO COMPOUND OR ITS SALT, ITS
PRODUCTION AND CONTROLLER
FOR HARMFUL ANIMAL CONTAINING
THE SAME



ABSTRACT : PURPOSE: To obtain a new amido compound useful as an active ingredient for a controller for harmful animals such as insecticide, acaricide, nematocide and agent for exterminating insect pests in soil by reacting a 4- trifluoromethylpyridine-3-carboxylic acid with a heterocyclic amine compound.

CONSTITUTION: A 4-trifluoromethylpyridine-3-carboxylic acid or its reactive derivative is reacted with a heterocyclic amine compound of the formula HN(R)- A-X [A is alkanediyl; X is (substituted) heterocyclic group; R is H or alkyl; with the proviso that when R is H and A is methylene, X is nonsubstituted pyridine, nonsubstituted thienyl or nonsubstituted furyl] (e.g. 5-trifluoromethyl-2 pyridylmethylamine) in the presence of a base such as triethylamine at room temperature for 18 hours to give the objective amido compound of the formula useful as an active ingredient for a controller for harmful animals such as insecticide, acaricide, nematocide and agent for destroying insect pests in soil.

COPYRIGHT: (C)1995,JPO

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平7-25853

(43) 公開日 平成7年(1995)1月27日

(51) Int.Cl. ⁸	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 213/82				
A 0 1 N 43/40	1 0 1 D	9155-4H		
43/42	1 0 1	9155-4H		
43/58	A	9155-4H		
43/60		9155-4H		

審査請求 未請求 請求項の数 3 F D (全 15 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平5-196888

(22) 出願日 平成5年(1993)7月14日

(71) 出願人 000000354

石原産業株式会社

大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号

(72) 発明者 小柳 徹

滋賀県草津市西波川二丁目3番1号 石原

産業株式会社中央研究所内

(72) 発明者 森田 雅之

滋賀県草津市西波川二丁目3番1号 石原

産業株式会社中央研究所内

(72) 発明者 米田 哲大

滋賀県草津市西波川二丁目3番1号 石原

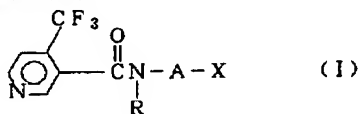
産業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アミド系化合物又はその塩、それらの製造方法及びそれらを含有する有害動物防除剤

(57) 【要約】 (修正有)

【構成】 一般式 (I) で表わされる新規なアミド系化合物又はその塩、それらの製造方法及びそれらを含有する有害動物防除剤。



(式中、Aはアルカンジイル基、Xは置換可複素環基、Rは水素原子又はアルキル基であり、但しRが水素原子でかつAがメチレン基であるとき、Xが無置換ピリジル、同チエニル及び同フリルであるものを除く) で表されるアミド系化合物又はその塩である。

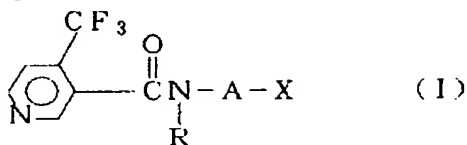
【効果】 一般式 (I) の化合物は殺虫、殺ダニ、殺線虫、殺土壌害虫剤などの有害動物防除剤の有効成分として優れた活性を示す。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式 (I) :

【化1】



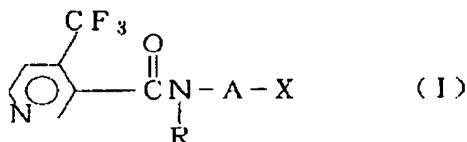
(式中、Aはアルカンジイル基であり、Xは置換されてもよい複素環基であり、Rは水素原子又はアルキル基であり、但し、Rが水素原子でかつAがメチレン基であるとき、Xが無置換のピリジル、同チエニル及び同フリルであるものを除く)で表されるアミド系化合物又はその塩。

【請求項2】 4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボン酸又はその反応性誘導体と一般式 (III) :

$$\text{HN}(\text{R})-\text{A}-\text{X} \quad (\text{III})$$

(式中、Aはアルカンジイル基であり、Xは置換されてもよい複素環基であり、Rは水素原子又はアルキル基であり、但し、Rが水素原子でかつAがメチレン基であるとき、Xが無置換のピリジル、同チエニル及び同フリルであるものを除く)で表される化合物とを反応させることを特徴とする一般式 (I)

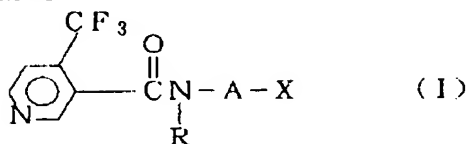
【化2】



(式中A、X、及びRは前述の通りである)で表されるアミド系化合物又はその塩の製造方法。

【請求項3】 一般式 (I) :

【化3】



(式中、Aはアルカンジイル基であり、Xは置換されてもよい複素環基であり、Rは水素原子又はアルキル基であり、但し、Rが水素原子でかつAがメチレン基であるとき、Xが無置換のピリジル、同チエニル及び同フリルであるものを除く)で表されるアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする有害動物防除剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

2

【産業上の利用分野】本発明は、アミド系化合物又はその塩、それらの製造方法及びそれらを有効成分として含有する有害動物防除剤に関する。

【0002】

【従来の技術】有害動物防除剤の有効成分としては種々の化合物が知られている。しかしながら、それらの化学構造は本発明のアミド系化合物とは異なる。

【0003】従来、有害動物防除剤例えば殺虫剤の有効成分として有機リン系、カーバメート系及びピレスロイド系化合物が使用されてきたが、結果として、近年一部の害虫がこれら殺虫剤に抵抗性を獲得するに至った。それゆえ、抵抗性を持つ害虫に対して有効な有害動物防除剤が希求されている。さらに、害虫に対してより効果が高く、魚類、甲殻類及び家畜により安全な、或いはより広いスペクトラムを有する新たな有害動物防除剤の研究、開発が行われている。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、有害動物防除作用を有するアミド系化合物、それらの製造方法及びそれらを含有する有害動物防除剤を提供することにある。

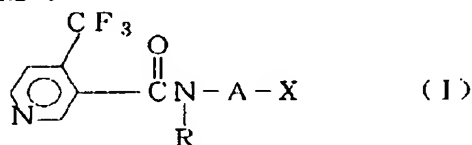
【0005】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、有害生物防除剤を開発すべく検討を重ね、特定の化学構造を有するアミド系化合物が優れた有害動物防除作用を持つとの知見を得、本発明を完成した。

【0006】すなわち、本発明は、一般式 (I) :

【0007】

【化4】



【0008】(式中、Aはアルカンジイル基であり、Xは置換されてもよい複素環基であり、Rは水素原子又はアルキル基であり、但し、Rが水素原子でかつAがメチレン基であるとき、Xが無置換のピリジル、同チエニル及び同フリルであるものを除く)で表されるアミド系化合物又はその塩、それらの製造方法及びそれらを含有する有害動物防除剤に関する。

【0009】一般式 (I) 中、Aのアルカンジイル基は炭素数1~6のもの、例えばメチレン基、エチレン基、プロピレン基、1, 1-エタンジイル基、1, 1-プロパンジイル基、1, 2-プロパンジイル基、2, 2-プロパンジイル基などがあげられる。

【0010】一般式 (I) 中、Xの複素環基は窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれた1~3つのヘテロ原子を含む5員又は6員の単環式又はフェニル縮合環

3

式基であり、例えば、ピリジル基、チエニル基、フリル基、ピラジニル基、3-ピリダジニル基、チアゾリル基、イソキサゾリル基、キノリル基などがあげられる。

【0011】一般式(I)中、Xの複素環の置換基としては、ハロゲン原子、C1-6アルキル、ハロC1-6アルキル、C1-6アルコキシ、ハロC1-6アルコキシ、C1-6アルキルチオ、C3-8シクロアルキル、C3-8シクロアルコキシ、C1-6アルコキシカルボニル、C1-6アルキルカルボニル、C1-6アルキルカルボニルオキシ、フェニル、フェノキシ、フェニルチオ、アミノ、C1-6アルキルが1ヶ乃至2ヶ置換したアミノ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシがあげられる。

【0012】一般式(I)中、Rのアルキル基は炭素数1~6のもの、例えばメチル基、エチル基、プロピル基*

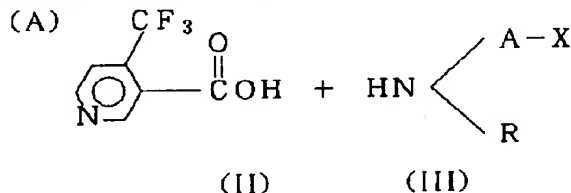
*基、ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基があげられ、炭素数が3以上のものは直鎖又は枝分かれ鎖の構造異性のものであってもよい。

【0013】一般式(I)の化合物は、酸性物質又は塩基性物質とともに塩を形成してもよく、酸性物質との塩としては塩酸塩、臭化水素酸塩、リン酸塩、硫酸塩、硝酸塩などの無機酸塩であってよく、塩基性物質との塩としてはナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、アンモニウム塩、ジメチルアミン塩などの無機或いは有機塩基塩であってよい。

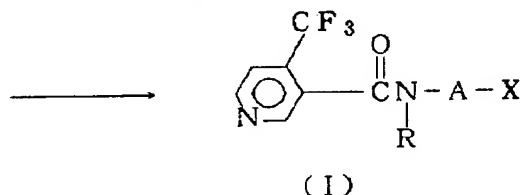
【0014】一般式(I)の化合物又はその塩は、例えば以下の(A)の方法により製造することができる。

【0015】

【化5】



又はその反応性誘導体



【0016】(式中、A、X及びRは前述の通りである)

【0017】式(II)で表される4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボン酸の反応性誘導体としては、酸ハロゲン化物、エステル又は酸無水物であってよい。

【0018】上記反応は、通常溶媒の存在下、必要により塩基の存在下で行われる。溶媒としては、例えばベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素；ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどのエーテル；塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭素化水素；アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ピリジンなどの非プロトン性極性溶媒などが含まれる。これらの溶媒は、単独で或は混合して使用してもよい。塩基としては、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジンなどの第三級アミン；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属炭酸化物；ナトリウムメトキシ

ド、ナトリウムエトキシドなどのアルカリ金属のアルコキシドなどが含まれる。反応物質が4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボン酸の場合には、ジシクロヘキシルカルボジイミド、N、N'-カルボニルジイミダゾール、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドなどの縮合剤が通常使用される。

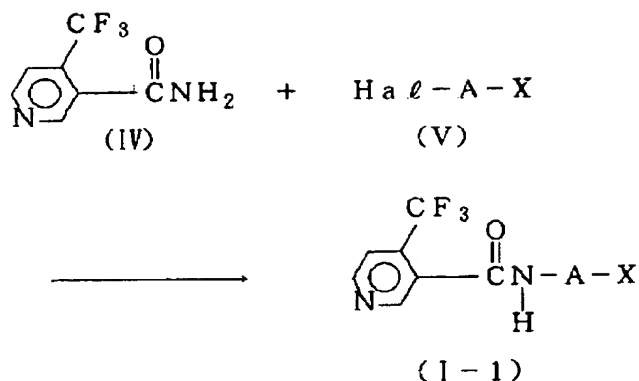
【0019】上記反応の反応温度は通常-50℃~+100℃であるが、反応性誘導体が酸ハロゲン化物又は酸無水物の場合には好ましくは0~30℃であり、また反応性誘導体がエステルの場合には好ましくは50~100℃である。反応時間は通常0.1~24時間である。

【0020】また、一般式(I)の化合物又はその塩は、例えば以下の(B)~(D)の方法により製造されてもよい。

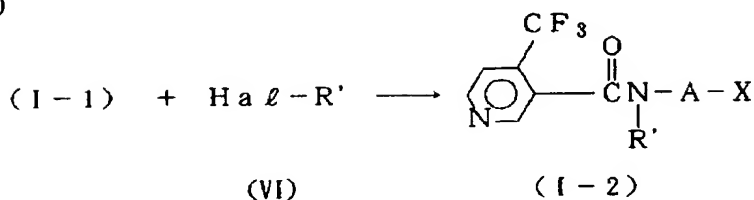
【0021】

【化6】

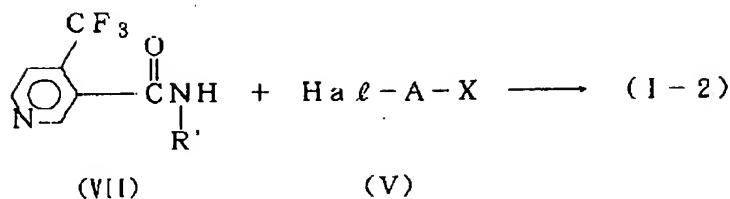
(B)



(C)



(D)



【0022】(式中、A及びXは前述の通りであり、Halはハロゲン原子であり、R'はアルキル基である)。

【0023】上記(B)～(D)の反応は、前述した(A)の反応と同様にして行うことができる。

【0024】式(II)の化合物、即ち4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸は公知の化合物であり、商業的に入手することができる。また、その反応性誘導体は、式(II)の化合物から取得することができる。

【0025】酸クロリドの合成は4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボン酸と塩化チオニル、三塩化リンなどの塩素化剤とを、必要により触媒量のN,N'-ジメチルホルムアミドの存在下に、還流温度で反応させることにより行われる。

【0026】4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカ

ルボニルクロリド以外の式(II)の反応性誘導体は、安息香酸からその反応性誘導体への公知の方法と同様の方法によって、取得することができる。例えば、酸臭化物は4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸と三臭化リン、オキシ臭化リン、臭化アセチルなどの臭素化剤と反応させることにより取得することができ、酸無水物は4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸とその塩化物又は乾燥剤とを反応させることにより取得することができ、そしてエステルは4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸とアルコールとを反応させることにより取得することができる。

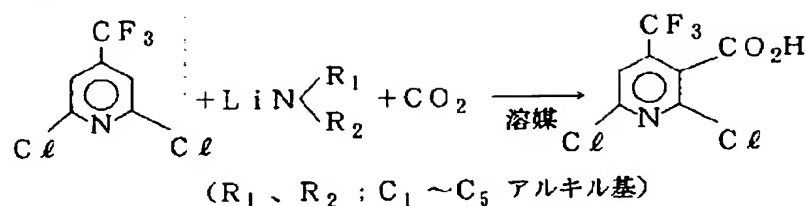
【0027】また、4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボン酸は、例えば以下の(E)の方法によっても取得することができる。

【0028】

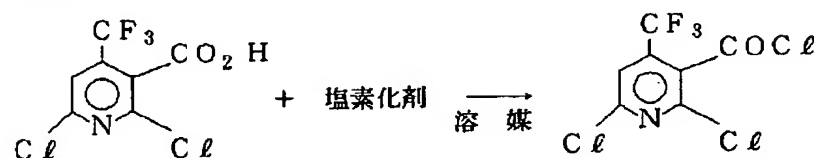
【化7】

(E)

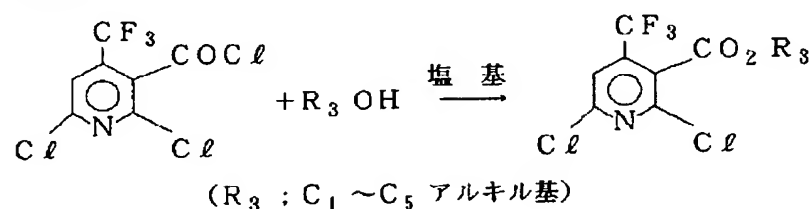
(工程1)



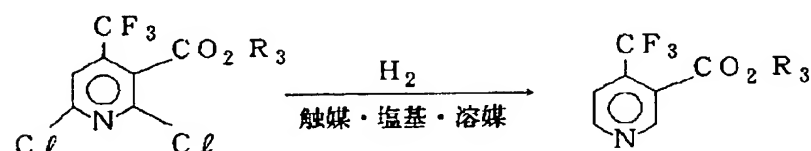
(工程2)



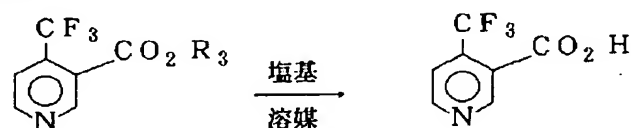
(工程3)



(工程4)



(工程5)



【0029】(工程1) 工程1は、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルピリジンをリチウムジアルキルアミド (好ましくは、リチウムジイソプロピルアミド) 及び溶媒の存在下で、気体或いは固体状の二酸化炭素と反応させることにより行われる。

【0030】溶媒としてはテトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類が用いられる。反応温度は通常-100℃~+20℃、好ましくは-80℃~-20℃であり、反応時間は1~12時間である。

【0031】(工程2) 工程2は、工程1で生成した

2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボン酸を溶媒の存在下で塩素化剤と反応させることにより行われる。

【0032】塩素化剤としては塩化チオニル、五塩化リンが用いられ、溶媒としてはベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素類が用いられる。反応温度は通常20~120℃、好ましくは50~100℃であり、反応時間は1~6時間である。

【0033】(工程3) 工程3は工程2で生成した、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルピリジン-3

ーカルボン酸塩化物を塩基の存在下でアルコールと反応させることにより行われる。

【0034】アルコールとしてはメタノール、エタノールなどのアルコール類が用いられ、塩基としてはトリエチルアミン、ピリジンなどの三級塩基が用いられる。反応温度は通常0～80℃、好ましくは20～50℃であり、反応時間は1～12時間である。

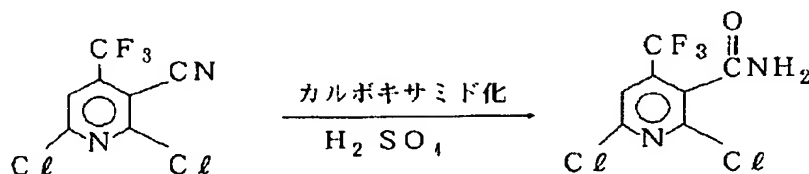
【0035】(工程1) 工程1は工程3で生成した2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-ピリジン-3-カルボン酸エステルと水素とを、溶媒、触媒及び塩基の存在下に反応させることにより行われる。

【0036】溶媒としてはメタノール、エタノールなどのアルコール類、テトラヒドロフランのようなエーテル類が用いられ、触媒としてはパラジウム、塩化パラジウム(II)などが用いられ、塩基としてはトリエチルアミン、ピリジンなどの三級塩基、酢酸ナトリウムなどが用いられる。反応温度は通常0～100℃、好ましくは20～50℃であり、反応時間は1～24時間である。

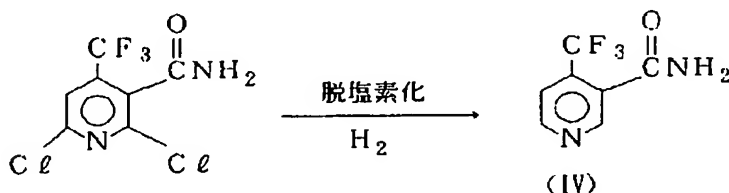
【0037】(工程5) 工程5は工程4で生成した4-*

(F)

(工程1)



(工程2)



【0041】(工程1) 工程1は、2, 6-ジクロロ-3-シアノ-4-トリフルオロメチルピリジン濃硫酸と反応させることにより行われる。

【0042】(工程2) 工程2は、前記工程1で得られる2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-3-ピリジンカルボキサミドと水素とを溶媒、触媒及び塩基の存在下に反応させることにより行われている。溶媒としては例えばメタノール、エタノールなどのアルコール類、テトラヒドロフランのようなエーテル類が使用され、触媒としては例えばパラジウム、塩化パラジウム(II)などが使用され、塩基としては例えば酢酸ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、トリエチルア

*トリフルオロメチルピリジン-3-カルボン酸エステルを塩基及び溶媒の存在下に反応させることにより行われる。

【0038】溶媒としては水；メタノール、エタノールなどのアルコール類が挙げられ、単独で又は混合して用いられる。塩基としては水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物が用いられる。反応温度は通常0～100℃、好ましくは20～80℃であり、反応時間は1～12時間である。

【0039】式(IV)の化合物、即ち4-トリフルオロメチルピリジン-3-カルボキサミドは、前記(A)の方法において式(III)の化合物の替りにアンモニアを反応させることにより取得することができる。また、2, 6-ジクロロ-3-シアノ-4-トリフルオロメチルピリジンから次の(F)の方法によっても取得することができる。

【0040】

【化8】

ミンなどが使用される。

【0043】工程2の反応の温度は通常0℃～100℃、反応時間は1～24時間である。

【0044】また、前記工程1において、2, 6-ジクロロ-3-シアノ-4-トリフルオロメチルピリジンの替りに2, 6-ジブromo-3-シアノ-4-トリフルオロメチルピリジンを用いても同様の反応を行うことができる。この2, 6-ジブromo-3-シアノ-4-トリフルオロメチルピリジンは、3-シアノ-2, 6-ジヒドロキシ-4-トリフルオロメチルピリジンを、オキシ臭化リンのような臭素化剤と反応させることにより得られる。

【0045】式(VII)の化合物は、前記(A)の方法において式(III)の化合物の替りに $R'NH_2$ を反応させることにより取得することができる。また、前記(B)の反応において式(V)の化合物の替りに式(VI)の化合物を反応させることにより取得することができる。

【0046】本発明化合物は殺虫、殺ダニ、殺線虫、殺土壌害虫などの有害動物防除剤の有効成分として優れた活性を示す。

【0047】例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、ミカンハダニ、ネダニなどの植物寄生性ダニ類、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシなどのアブラムシ類、コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリング、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類などの農業害虫類、イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカなどの衛生害虫類、バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類などの貯殺害虫類、イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類などの衣類、家屋害虫類、その他家畜などに寄生するノミ類、シラミ類、ハエ類などに対しても有効であり、更にはネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシガラセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウなどの植物寄生性線虫類に対しても有効である。また、土壌害虫類に対しても有効である。ここに言う土壌害虫としては、ナメクジ、マイマイなどの腹足類、ダンゴムシ、フラジムシなどの等脚類などがあげられる。なかでも、本発明化合物はモモアカアブラムシ、ワタアブラムシなどのアブラムシ類に卓越した効果を示す。更にアブラムシ類などの有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤抵抗性害虫に対しても有効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を土壌に処理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。

【0048】本発明化合物を有害動物防除剤の有効成分として使用するに際しては、従来の農薬の製剤の場合と同様に農薬補助剤と共に乳剤、懸濁剤、粉剤、粒剤、水和剤、水溶剤、液剤、フロアブル剤、顆粒水和剤、エアゾール剤、ペースト剤、微量散布剤などの種々の形態に製剤することができる。これらの配合割合は通常有効成分0.1~90重量部で農薬補助剤10~99.9重量部である。これらの製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、または水等の希釈剤で所定濃度に希釈して使用することができる。

【0049】ここにいる農薬補助剤としては、担体、乳化剤、懸濁剤、分散剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、増粘剤、安定剤などが挙げられ、必要により適宜添加すれば

よい。担体としては、固体担体と液体担体に分けられ、固体担体としては、澱粉、活性炭、大豆粉、小麦粉、木粉、魚粉、粉乳などの動植物性粉末、タルク、カオリン、ベントナイト、炭酸カルシウム、ゼオライト、珪藻土、ホワイトカーボン、クレイ、アルミナなどの鉱物性粉末が挙げられ、液体担体としては、水、イソプロピルアルコール、エチレングリコールなどのアルコール類、シクロヘキサノン、メチルエチルケトンなどのケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフランなどのエーテル類、ケロシン、軽油などの脂肪族炭化水素類、キシレン、トリメチルベンゼン、テトラメチルベンゼン、メチルナフタリン、ソルベントナフサなどの芳香族炭化水素類、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素類、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類、脂肪酸のグリセリンエステルなどのエステル類、アセトニトリルなどのニトリル類、ジメチルスルホキシドなどの含硫化合物類などが挙げられる。

【0050】また、必要に応じて他の農薬、例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、除草剤、植物生長調整剤などと混用、併用することができ、この場合に一層優れた効果を示すこともある。

【0051】上記殺虫剤、殺ダニ剤、或いは殺線虫剤の有効成分化合物としては、例えばO-(4-プロモ-2-クロロフェニル) O-エチルS-プロピルホスホロチオエート(一般名:プロフェノホス)、O-(2,2-ジクロロビニル) O, O-ジメチルホスフェート(一般名:ジクロルホス)、O-エチル O-[3-メチル-4-(メチルチオ)フェニル] N-イソプロピルホスホロアミデート(一般名:フェナミホス)、O, O-ジメチル O-(4-ニトロ-m-トリル)ホスホロチオエート(一般名:フェニトロチオン)、O-エチル O-(4-ニトロフェニル)フェニルホスホノチオエート(一般名:EPN)、O, O-ジエチル O-(2-イソプロピル-6-メチルピリミジン-4-イル)ホスホロチオエート(一般名:ダイアジノン)、O, O-ジメチル O-(3,5,6-トリクロロ-2-ピリジル)ホスホロチオエート(一般名:クロルピリホスメチル)、O, S-ジメチル N-アセチルホスホロアミドチオエート(一般名:アセフェート)、O-(2,4-ジクロロフェニル) O-エチル S-プロピルホスホロジチオエート(一般名:プロチオホス)、(RS)-S-sec-ブチルO-エチル 2-オキソ-1,3-チアゾリジン-3-イルホスホノチオエート(米国特許No.4590182に記載の化合物)などの有機リン酸エステル系化合物;

【0052】1-ナフチル N-メチルカーバメート(一般名:カルバリル)、2-イソプロポキシフェニル N-メチルカーバメート(一般名:プロボキシル)、2-メチル-2-(メチルチオ)プロピオンアルデヒド

〇-メチルカルバモイルオキシム (一般名: アルジカルブ)、2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチルベンゾフラン-7-イル N-メチルカーバメート (一般名: カルボフラン)、ジメチルN, N'-[チオビス{(メチルイミノ)カルボニルオキシ}]ビスエタンイミドチオエート (一般名: チオジカルブ)、S-メチル N-(メチルカルバモイルオキシ)チオアセトイミデート (一般名: メソミル)、N, N-ジメチル-2-メチルカルバモイルオキシイミノ-2-(メチルチオ)アセトアミド (一般名: オキサミル)、2-(エチルチオメチル)フェニル N-メチルカーバメート (一般名: エチオフェンカルブ)、2-ジメチルアミノ-5, 6-ジメチルピリミジン-4-イル N, N-ジメチルカーバメート (一般名: ピリミカブ)、2-sec-ブチルフェニル N-メチルカーバメート (一般名: フェノブカルブ) などのカーバメート系化合物;

【0053】S, S'-2-ジメチルアミノトリメチレンビス(チオカーバメート) (一般名: カルタップ)、N, N-ジメチル-1, 2, 3-トリチアン-5-イルアミン (一般名: チオシクラム) などのネライストキン誘導体;

【0054】2, 2, 2-トリクロロ-1, 1-ビス(4-クロロフェニル)エタノール (一般名: ジコホル)、4-クロロフェニル-2, 4, 5-トリクロロフェニルスルホン (一般名: テトラジホン) などの有機塩素系化合物;

【0055】ビス[トリス(2-メチル-2-フェニルプロピル)チン]オキシド (一般名: 酸化フェンブタズ) のような有機金属系化合物;

【0056】(RS)- α -シアノ-3-フェノキシベンジル(RS)-2-(4-クロロフェニル)-3-メチルブチレート (一般名: ファンパレレート)、3-フェノキシベンジル(1RS)-シス, トランス-3-(2, 2-ジクロロビニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (一般名: ベルメトリン)、(RS)- α -シアノ-3-フェノキシベンジル(1RS)-シス, トランス-3-(2, 2-ジクロロビニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (一般名: シベルメトリン)、(S)- α -シアノ-3-フェノキシベンジル(1R)-シス-3-(2, 2-ジプロモビニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (一般名: テルタメトリン)、(RS)- α -シアノ-3-フェノキシベンジル(1RS)-シス, トランス-3-(2-クロロ-3, 3, 3-トリフルオロプロペニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (一般名: シハロトリン)、4-メチル-2, 3, 5, 6-テトラフルオロベンジル-3-(2-クロロ-3, 3, 3-トリフルオロ-1-プロペニル)-2, 2-ジメチルシクロプロパンカルボキシレート (一般名: テフルトリン)、2-(4-エトキシ

フェニル)-2-メチルプロピル 3-フェノキシベンジルエーテル (一般名: エトフェンブロックス) などのピレスロイド系化合物;

【0057】1-(4-クロロフェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア (一般名: ジフルベンズロン)、1-(3, 5-ジクロロ-4-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ)フェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア (一般名: クロルフルアズロン)、1-(3, 5-ジクロロ-2, 4-ジフルオロフェニル)-3-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)ウレア (一般名: テフルベンズロン) などのベンゾイルウレア系化合物;

【0058】イソプロピル (2E, 4E)-11-メトキシ-3, 7, 11-トリメチル-2, 4-ドテカジエノエート (一般名: メトブレン) のような幼若ホルモン様化合物;

【0059】2-t-ブチル-5-(4-t-ブチルベンジルチオ)-4-クロロ-3(2H)-ピリダジノン (一般名: ピリダベン) のようなピリダジノン系化合物;

【0060】t-ブチル 4-{(1, 3-ジメチル-5-フェノキシピラゾール-4-ニル)メチレンアミノオキシメチル}ベンゾエート (一般名: フェンピロキシメート)、5-アミノ-1-(2, 6-ジクロロ- α , α -トリフルオロ-p-トルイル)-4-トリフルオロメチルスルフィニルピラゾール-3-カルボニトリル (一般名: フィプロニル)、N-(4-t-ブチルベンジル)-4-クロロ-3-エチル-1-メチルピラゾール-5-カルボキサミド (一般名: テブフェンピラド) などのピラゾール系化合物;

【0061】1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-ニトロ-イミダゾリジン-2-イリデンアミン (一般名: イミダクロプリド)、1-[N-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-N-エチルアミノ]-1-メチルアミノ-2-ニトロエチレン (一般名: ニテンピラム)、N¹-(6-クロロ-3-ピリジル)メチル-N²-シアノN¹-メチルアセトアミジン (ヨーロッパ公開NO. 456826に記載の化合物) 1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-2-(1-ニトロ-2-アリルチオエチリデン)イミダゾリジン (ヨーロッパ公開NO. 437784)、1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-2-(1-ニトロ-2-エチルチオエチリデン)イミダゾリジン (ヨーロッパ公開NO. 437784)、1-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-2-(1-ニトロ-2- β -メチルアリルチオエチリデン)イミダゾリジン (ヨーロッパ公開NO. 437784) などのニトロ系化合物;

【0062】N'-t-ブチル-N'-3, 5-ジメチルベンゾイル-N-ベンゾ[b]チオフェン-2-カルボヒドラジド、N'-t-ブチル-N'-3, 5-ジメ

チルベンゾイル-N-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-カルボヒドラジド、N'-t-ブチル-N'-3, 5-ジメチルベンゾイル-N-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-カルボヒドラジド、N'-t-ブチル-N'-3', 5'-ジメチルベンゾイル-N-4-エチルフェニルカルボヒドラジド (一般名: テブフェノジド) などのヒドラジン系化合物;

【0063】ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化合物、ヒドラゾン系化合物また、その他の化合物として、2-t-ブチルイミノ-3-イソプロピル-5-フェニル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2H-1, 3, 5-チアジアジン-4-オン (一般名: ププロフェジン)、トランス- (4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシル-4-メチル-2-オキソチアゾリジノン-3-カルボキサミド (一般名: ヘキシチアゾクス)、N-メチルビス (2, 4-キシリルイミノメチル) アミン (一般名: アミトラズ)、N'- (4-クロロ-オ-トリル)-N, N-ジメチルホルムアミン (一般名: クロルジメホルム)、 (4-エトキシフェニル)- (3- (4-フルオロ-3-フェノキシフェニル) プロピル) (ジメチル) シラン (一般名: シラフルオフェン)、エチル (3-t-ブチル-1-ジメチルカルバモイル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオ) アセテート (一般名: トリアザメイト)、4, 5-ジヒドロ-6-メチル-4- (3-ピリジルメチレンアミノ)-1, 2, 4-トリアジン-3 (2H)-オン (一般名: ビメトロジン)、5-クロロ-N- (2- (4- (2-エトキシエチル)-2, 3-ジメチルフェノキシ) エチル)-6-エチルピリミジン-4-アミン (一般名: ピリミジフェン)、4-プロモ-2- (4-クロロフェニル)-1-エトキシメチル-5-トリフルオロメチルピロール-3-カルボニトリル (特開平1-104042号公報に記載の化合物) などの化合物が挙げられる。更に、BT剤、昆虫病原ウイルス剤などの微生物農薬、アベルメクチン、ミルベマイシンなどの抗生物質などと、混用、併用することもできる。

【0064】上記殺菌剤の有効成分化合物としては、例えば、2-アニリノ-4-メチル-6- (1-プロピニル) ピリミジン (日本特開昭63-208581に記載の化合物) のようなピリミジナミン系化合物;

【0065】1- (4-クロロフェノキシ)-3, 3-ジメチル-1- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタノン (一般名: トリアジメホン)、1- (ピフェニル-4-イルオキシ)-3, 3-ジメチル-1- (1H, 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール (一般名: ビテルタノール)、1- [N- (4-クロロ-2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロボキシアセトイミドイル] イミダゾール

(一般名: トリフルミゾール)、1- (2- (2, 4-ジクロロフェニル)-4-エチル-1, 3-ジオキサラン-2-イルメチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール (一般名: エタコナゾール)、1- (2- (2, 4-ジクロロフェニル)-4-プロピル-1, 3-ジオキサラン-2-イルメチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール (一般名: プロピコナゾール)、1- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) ペンチル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール (一般名: ペンコナゾール)、ビス (4-フルオロフェニル) (メチル) (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル) シラン (一般名: フルシラゾール)、2- (4-クロロフェニル)-2- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル) ヘキサンニトリル (一般名: マイクロブタニル)、 (2R, 3R)-2- (4-クロロフェニル)-3-シクロプロピル-1- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ブタン-2-オール (一般名: シプロコナゾール)、 (RS)-1- (4-クロロフェニル)-4, 4-ジメチル-3- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル) ペンタン-3-オール (一般名: タ-ブコナゾール)、 (RS)-2- (2, 4-ジクロロフェニル)-1- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) ヘキサン-2-オール (一般名: ヘキサコナゾール)、 (2RS, 5RS)-5- (2, 4-ジクロロフェニル) テトラヒドロ-5- (1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)-2-フリル2, 2, 2-トリフルオロエチルエーテル (一般名: ファーコナゾールシス)、N-プロピル-N- (2- (2, 4, 6-トリクロロフェノキシ) エチル) イミダゾール-1-カルボキサミド (一般名: プロクロラズ) などのアゾール系化合物;

【0066】6-メチル-1, 3-ジチオ [4, 5-b] キノキサリン-2-オン (一般名: キノメチオネト) のようなキノキサリン系化合物;

【0067】マンガニ-ズエチレンビス (ジチオカーバメート) の重合体 (一般名: マンネブ)、ジnkエチレンビス (ジチオカーバメート) の重合体 (一般名: ジネブ)、ジnk (亜鉛) とマンガニ-ズエチレンビス (ジチオカーバメート) (マンネブ) の錯化合物 (一般名: マンゼブ)、ジジnkビス (ジメチルジチオカーバメート) エチレンビス (ジチオカーバメート) (一般名: ポリカーバメート)、ジnkプロピレンビス (ジチオカーバメート) の重合体 (一般名: プロピネブ) などのジチオカーバメート系化合物;

【0068】4, 5, 6, 7-テトラクロロフタリド (一般名: フサライド)、テトラクロロイソフタロニトリル (一般名: クロロタロニル)、ペンタクロロニトロベンゼン (一般名: キントゼン) などの有機塩素系化合物;

【0069】メチル 1- (ブチルカルバモイル) ペン

ズイミダゾール-2-イルカーバメート（一般名：ベノミル）、ジメチル4, 4'-（o-フェニレン）ビス（3-チオアロファネート）（一般名：チオファネートメチル）、メチルベンズイミダゾール-2-イルカーバメート（一般名：カーベンダジム）などのベンズイミダゾール系化合物；

【0070】3-クロロ-N-（3-クロロ-2, 6-ジニトロ-4- α , α -トリフルオロトリル）-5-トリフルオロメチル-2-ピリジナミン（一般名：フルアジナム）のようなピリジナミン系化合物；

【0071】1-（2-シアノ-2-メトキシイミノアセチル）-3-エチル尿素（一般名：シモキサニル）のようなシアノアセトアミド系化合物；

【0072】メチル N-（2-メトキシアセチル）-N-（2, 6-キシリル）-DL-アラニネート（一般名：メタラキシル）、2-メトキシ-N-（2-オキソ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル）アセト-2', 6'-キシリジド（一般名：オキサジキシル）、（ \pm ）- α -2-クロロ-N-（2, 6-キシリルアセトアミド）- γ -ブチロラクトン（一般名：オフレース）、メチル N-フェニルアセチル-N-（2, 6-キシリル）-DL-アラニネート（一般名：ベナラキシル）、メチル N-（2-フロイル）-N-（2, 6-キシリル）-DL-アラニネート（一般名：フララキシル）、（ \pm ）- α -[N-（3-クロロフェニル）シクロプロパンカルボキサミド]- γ -ブチロラクトン（一般名：シプロフラン）などのフェニルアミド系化合物；

【0073】N-ジクロロフルオロメチルチオ-N', N'-ジメチル-N-フェニルスルファミド（一般名：ジクロフルアニド）のようなスルフェン酸系化合物；

【0074】水酸化第二銅（一般名：水酸化第二銅）、銅 8-キノリノレート（一般名：有機銅）などの銅系化合物；

【0075】5-メチルイソキサゾール-3-オール（一般名：ヒドロキシイソキサゾール）のようなイソキサゾール系化合物；

【0076】アルミニウムトリス（エチルホスホネート）（一般名：ホセチルアルミニウム）、O-2, 6-ジクロロ-p-トリル-O, O-ジメチルホスホチオエート（一般名：トルクロホス-メチル）、S-ベンジル O, O-ジイソプロピルホスホチオエート、O-エチル S, S-ジフェニルホスホジチオエート、アルミニウムエチルハイドロゲンホスホネートなどの有機リン系化合物；

【0077】N-（トリクロロメチルチオ）シクロヘキシー-4-エン-1, 2-ジカルボキシミド（一般名：キャプタン）、N-（1, 1, 2, 2-テトラクロロエチルチオ）シクロヘキシー-4-エン-1, 2-ジカルボキシミド（一般名：キャプタホル）、N-（トリクロロメチルチオ）フタルイミド（一般名：フォルベット）など

のN-ハロゲノチオアルキル系化合物；

【0078】N-（3, 5-ジクロロフェニル）-1, 2-ジメチルシクロプロパン-1, 2-ジカルボキシミド（一般名：プロシミドン）、3-（3, 5-ジクロロフェニル）-N-イソプロピル-2, 4-ジオキソイミダゾリジン-1-カルボキサミド（一般名：イプロジオン）、（RS）-3-（3, 5-ジクロロフェニル）-5-メチル-5-ビニル-1, 3-オキサゾリジン-2, 4-ジオン（一般名：ピンクロゾリン）などのジカルボキシイミド系化合物；

【0079】 α , α , α -トリフルオロ-3'-イソプロポキシ- α - α -トリフルオロニリド（一般名：フルトラニル）、3'-イソプロポキシ- α - α -トリフルオロニリド（一般名：メプロニル）などのベンズアニリド系化合物；

【0080】2-（1, 3-ジメチルピラゾール-4-イルカルボニルアミノ）-4-メチル-3-ペンテンニトリル（英国特許NO. 2190375に記載の化合物）、 α -（ニコチルアミノ）-（3-フルオロフェニル）アセトニトリル（日本特開昭63-135364に記載の化合物）などのベンズアミド系化合物；

【0081】N, N'-[ビベラジン-1, 4-ジイルビス〔（トリクロロメチル）メチレン〕]ジホルムアミド（一般名：トリホリン）のようなビベラジン系化合物；

【0082】2', 4'-ジクロロ-2-（3-ピリジル）アセトフェノン O-メチルオキシム（一般名：ピリフェノックス）のようなピリジン系化合物；

【0083】（ \pm ）-2, 4'-ジクロロ- α -（ピリミジン-5-イル）ベンズヒドリルアルコール（一般名：フェナリモル）、（ \pm ）-2, 4'-ジフルオロ- α -（1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル）ベンズヒドリルアルコール（一般名：フルトリアフォル）などのカルビノール系化合物；

【0084】（RS）-1-〔3-（4-ターシャリーブチルフェニル）-2-メチルプロピル〕ビベリジン（一般名：フェンプロビディン）のようなビベリジン系化合物；

【0085】（ \pm ）-シス-4-〔3-（4-ターシャリーブチルフェニル）-2-メチルプロピル〕-2, 6-ジメチルモルフォリン（一般名：フェンプロビモルフ）のようなモルフォリン系化合物；

【0086】トリフェニルチンヒドロキシド（一般名：フェンチンヒドロキシド）、トリフェニルチンアセテート（一般名：フェンチンアセテート）などの有機スズ系化合物；

【0087】1-（4-クロロベンジル）-1-シクロペンチル-3-フェニルウレア（一般名：ペンシキエロン）のような尿素系化合物；

【0088】（E, Z）4-〔3-（4-クロロフェニル）-3-（3, 4-ジメトキシフェニル）アクリロイ

ル) モルフォリン (一般名: ジメトモルフ) のようなシ
ンナミック酸系化合物;

【0089】イソプロピル 3, 4-ジエトキシカルバ
ニレート (一般名: ジエトフェンカルブ) のようなフェ
ニルカーバメート系化合物;

【0090】3-シアノ-4-(2, 2-ジフルオロ
1, 3-ベンゾジオキソール-4-イル) ピロール (商
品名: サファイヤ)、3-(2', 3'-ジクロロフェ
ニル)-4-シアノ-ピロール (一般名: フェンビクロ
ニル) などのシアノピロール系化合物;

【0091】3-クロロ-N-(3-クロロ-2, 6-
ジニトロ-4- α , α , α -トリフルオロトリル)-5
-トリフルオロメチル-2-ビリジナミン (一般名: フ
ルアジナム) のようなビリジナミン系化合物;

【0092】アトラキノン系化合物; クロトン酸系化
合物; 抗生物質またその他の化合物として、ジイソプロピ
ル 1, 3-ジチオラン-2-イリデン-マロネート (一
般名: イソプロチオラン)、5-メチル-1, 2, 4-
トリアゾロ [3, 4-b] ペンチアゾール (一般名: ト
リシクラゾール)、1, 2, 5, 6-テトラヒドロピロ
ロ (3, 2, 1-ij) キノリン-4-オン (一般名:
ピロキロン)、6-(3, 5-ジクロロ-4-メチルフ
ェニル)-3 (2H)-ピリダジノン (一般名: ジクロ
メジン)、3-アリルオキシ-1, 2-ベンゾイソチア
ゾール-1, 1-ジオキシド (一般名: プロベナゾ
ール) などが挙げられる。

【0093】また、本発明化合物と混用、併用する相手
剤との適当な混合重量比は一般に 1:300~300:
1、望ましくは 1:100~100:1 である。

【0094】本発明の有害動物防除剤の施用は、一般に
0.1~500000ppm 望ましくは 1~10000
0ppm の有効成分濃度で行なう。これらの有効成分濃
度は、製剤の形態及び施用する方法、目的、時期、場所
及び害虫の発生状況等によって適当に変更できる。例え
ば、水生有害虫の場合、上記濃度範囲の薬液を発生場所
に散布しても防除できることから、水中での有効成分濃
度範囲は上記以下である。単位面積あたりの施用量は 1
ha 当り、有効成分化合物として約 0.1~5000g
好ましくは 10~1000g が使用される。しかし、特
別の場合には、これらの範囲を逸脱することも可能であ
る。

【0095】本発明化合物を含有する種々の製剤、また
はその希釈物の施用は、通常一般に行なわれている施用
方法すなわち、散布 (例えば散布、噴霧、ミスティン
グ、アトマイジング、散粒、水面施用等)、土壌施用
(混入、灌注等)、表面施用 (塗布、粉衣、被覆等)、
浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対し

て前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での
有害虫、特に有害昆虫の発生生育を防除することも可能
である。またいわゆる超高濃度少量散布法 (ultra
low volume) により施用することもでき
る。この方法においては、活性成分を 100% 含有する
ことが可能である。

【0096】また、本発明の有害動物防除剤の施用に
は、有害動物に直接施用する場合の他に、式 (I) のア
ミド系化合物又はその塩が有害動物に作用するいかなる
場合の施用をも含むものとする。そのような例として
は、他の有効成分化合物が土壌などの環境中で式 (I)
のアミド系化合物に分解された後、有害動物に作用する
ような場合が挙げられる。

【0097】

【実施例】以下に本発明の実施例を記載するが、本発明
はこれら実施例のみに限定されるものではない。

【0098】合成例

N-[(5-トリフルオロメチル)-2-ビリジルメチ
ル]-4-トリフルオロメチル-3-ビリジカルボキ
サミド (化合物 No. 1) の合成

【0099】(1) 5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ジルメチルアミンの合成

2-シアノ-5-トリフルオロメチルビリジン 1.5g
のエタノール 15ml 溶液に 10% パラジウム炭素 0.
15g を加え、水素加圧下で 15 時間攪拌した。反応終
了後、還元触媒をセラライトで除去し、ろ液を濃縮して 5
-トリフルオロメチル-2-ビリジルメチルアミンの粗
生成物 1.0g を得た。このものは精製せずに次の反応
に用いた。

(2) 4-トリフルオロメチル-3-ビリジカルボン
酸 0.40g と塩化チオニル 0.50g のベンゼン 10
ml 溶液を触媒量のジメチルホルムアミドの存在下に 3
0 分間加熱還流した。過剰の塩化チオニルとベンゼンを
減圧留去後、残渣をテトラヒドロフラン 15ml に溶解
した。これにトリエチルアミン 0.42g と前記 (1)
で得られた 5-トリフルオロメチル-2-ビリジルメチ
ルアミン 1.0g を加え室温で 18 時間攪拌後、水に注ぎ
酢酸エチルで抽出した。有機層を塩化アンモニウム水溶
液、水、飽和食塩水で洗い、無水硫酸ナトリウムで乾燥
後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト
グラフィーで精製して融点 133.5~137℃ の目的
物 (化合物 No. 1) 0.34g を得た。

【0100】本発明によって製造された一般式 (I) の
化合物を表 1~表 3 に記載する。

【0101】

【表 1】

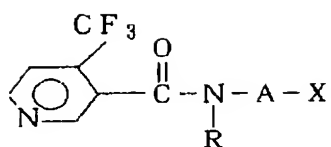


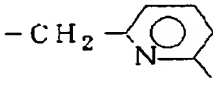
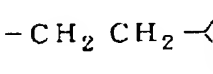
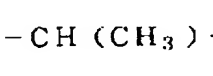
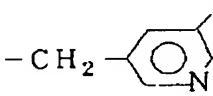
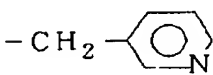
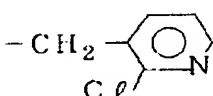
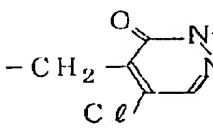
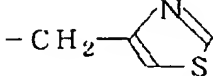
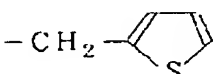
表 1

化合物 No.	-A-X	R	物 性
1	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{CF}_3$	H	m. p. 133.5 - 137°C
2	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}$	H	m. p. 163 - 170°C
3	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}$	H	m. p. 147 - 149°C
4	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$	H	m. p. 101 - 103.5°C
5	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_4-\text{N}$	H	m. p. 194 - 201°C
6	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}$	H	m. p. 144 - 148 °C
7	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{Cl})_2-\text{N}$	H	m. p. 110 - 113°C
8	$-\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N}$	-CH ₃	m. p. 81 - 82.5°C

【0102】

【表2】

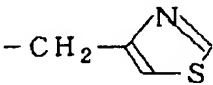
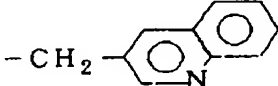
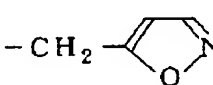
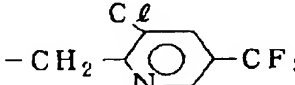
表 2

化合物 No	-A-X	R	物 性
9		H	m. p. 86-92°C
10		H	m. p. 89.5-91.5°C
11		H	m. p. 100.5 -101.5°C
12		H	m. p. 177-179°C
13		H	m. p. 141-147°C
14		H	m. p. 145.5-147°C
15		H	m. p. 120-123°C
16		H	m. p. 125-127°C
17		H	油状物質

{0103}

【表3】

表 3

化合物 No.	- A - X	R	物 性
18		H	m. p. 98-102°C
19		H	m. p. 175-177°C
20		H	m. p. 83-86°C
21		H	m. p. 112-117°C

【0104】試験例1 モモアカアブラムシ殺虫試験
有効成分化合物のそれぞれの製剤品を水に分散させ、濃度を800ppmに調整した。本葉1枚のみを残したポット（直径8cm、高さ7cm）植えナスの葉柄に粘着剤を塗布した後、その本葉にモモアカアブラムシ無翅胎生雌成虫を2〜3頭接種し、産仔させた。接種2日後成虫を除去し、幼虫数をかぞえた。この幼虫の寄生したナス葉を前記の濃度に調整した薬液に約10秒間浸漬処理し、風乾後26℃の照明付恒温室内に放置した。処理後5日目に生死を判定し、下記の計算式により死虫率を求めた。なお、離脱虫は死亡したものとみなした。

【0105】
死虫率(%) = 死虫数 / 処理虫数 × 100

【0106】化合物NO. 1〜4及び6〜21が100%の死虫率を、また化合物NO. 5は90〜99%の死虫率を示した。

【0107】試験例2 モモアカアブラムシ浸透移行性試験

有効成分化合物のそれぞれの製剤品を水に分散させ、濃度を800ppmに調整した。本葉1枚のみを残したポット（直径8cm、高さ7cm）の植えナスの葉柄に粘着剤を塗布した後、その本葉にモモアカアブラムシ無翅胎生雌成虫を2〜3頭接種し、産仔させた。接種2日後成虫を除去し、幼虫数をかぞえた。この幼虫の寄生したナスに、前記の濃度に調整した薬液10mlを土壌澆注処理し、26℃の照明付恒温室内に放置した。処理5日後に生死を判定し、前記試験例1の場合と同様にて死虫率を求めた。なお、離脱虫は死亡したものとみなした。

【0108】化合物No. 1〜4、7、8、12及び13が100%の死虫率を示した。

【0109】次に本発明の製剤例を記載するが、本発明における化合物、配合割合、剤型などは下記の記載例のみに限定されるものではない。

【0110】製剤例1

(イ) 化合物No. 1 20重量部
(ロ) カオリン 72重量部
(ハ) リグニンスルホン酸ソーダ 8重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

【0111】製剤例2

(イ) 化合物No. 4 5重量部
(ロ) タルク 95重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

【0112】製剤例3

(イ) 化合物No. 2 20重量部
(ロ) N, N'-ジメチルアセトアミド 20重量部
(ハ) ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル 10重量部

(ニ) キシレン 50重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

【0113】製剤例4

(イ) カオリン 68重量部
(ロ) リグニンスルホン酸ソーダ 2重量部
(ハ) ポリオキシエチレンアルキルアリールサルフェート 5重量部
(ニ) 微粉シリカ 25重量部

以上の各成分の混合物と化合物No. 5とを4:1の重

(15)

特開平7-25853

27

量割合で混合し、水和剤とする。

【0114】製剤例5

(イ) 化合物No. 12 50重量部

(ロ) オキシレーテッドポリアルキルフェニルフォス
フェートトリエタノールアミン 2重量部

(ハ) シリコーン 0.2重量部

(ニ) 水 47.8重量部

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

(ホ) ポリカルボン酸ナトリウム 5重量部

(ヘ) 無水硫酸ナトリウム 42.8重量部

を加え均一に混合、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0115】製剤例6

(イ) 化合物No. 6 5重量部

(ロ) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル
1重量部(ハ) ポリオキシエチレンの燐酸エステル
0.1重量部

(ニ) 粒状炭酸カルシウム 93.5重量部

(イ) ~ (ハ) を予め均一に混合し、適量のアセトンで
希釈した後、(ニ) に吹付け、アセトンを除去して顆粒
とする。

【0116】製剤例7

28

(イ) 化合物No. 16 2.5重量部

(ロ) N-メチル-2-ピロリドン 2.5重量部

(ハ) 大豆油 95.0重量部

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤 (ultra
low volume formulation) とする。

【0117】製剤例8

(イ) 化合物No. 3 5重量部

(ロ) N, N'-ジメチルアセトアミド 15重量部

10 (ハ) ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル
10重量部

(ニ) キシレン 70重量部

以上のものを均一に混合し乳剤とする。

【0118】製剤例9

(イ) 化合物No. 7 20重量部

(ロ) ラウリルサルフェートナトリウム塩 3重量部

(ハ) 水溶性デンプン 77重量部

以上のものを均一に混合し、水溶剤とする。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 3	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 01 N 43/78		B 9155-4H		
43/80	1 0 1	9155-4H		
C 07 D 401/12	2 1 3			
405/12	2 1 3			
409/12	2 1 3			
413/12	2 1 3			
417/12	2 1 3			

(72) 発明者 梶本 千晴

滋賀県草津市西浜川二丁目3番1号 石原
産業株式会社中央研究所内

